(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2005 年10 月13 日 (13.10.2005)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 2005/094885 A1

(51) 国際特許分類⁷: **A61K 45/00**, 31/522, A61P 3/00, 19/02, 19/04, 21/00, 29/00, 43/00 // C07D 473/06, 473/12

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2005/006033

(22) 国際出願日:

2005年3月30日(30.03.2005)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特願2004-097422 2004年3月30日(30.03.2004) JI

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 協和▲醗 ▼酵工業株式会社 (KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1008185 東京都千代田区大手町一丁 目6番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 加瀬 廣 (KASE, Hiroshi) [JP/JP]. ▲高▼橋 勇美 (TAKAHASHI, Isami) [JP/JP]. 九里 俊二 (KUNORI, Shunji) [JP/JP]. 小林 実 (KOBAYASHI, Minoru) [JP/JP]. 塩崎 静男 (SH-IOZAKI, Shizuo) [JP/JP]. 白倉 史郎 (SHIRAKURA, Shiro) [JP/JP]. (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一 国際調査報告書

請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受 領の際には再公開される。

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PREVENTIVE AND/OR THERAPEUTIC AGENT FOR DISEASE ACCOMPANIED BY CHRONIC MUSCLE/SKELETON PAIN

(54) 発明の名称: 慢性筋骨格痛を呈する疾患の予防および/または治療剤

$$\begin{array}{c|cccc}
R^1 & X^2 & R^3 \\
\hline
 & N & N & R^4 \\
 & X^1 & N & R^4
\end{array}$$
(I)

$$Y^1$$
 Y^2
(II)

(57) Abstract: A preventive and/or therapeutic agent for diseases accompanied by a chronic muscle/skeleton pain, which contains as an active ingredient either a compound having antagonistic activity against an adenosine A_{2A} receptor, such as, e.g., a xanthine derivative represented by the following formula (I) (wherein R¹, R², and R³ are the same or different and each represents hydrogen, lower alkyl, lower alkenyl, or lower alkynyl; R⁴ represents cycloalkyl, -(CH₂)_n-R⁵, or the following formula (II); and X¹ and X² are the same or different and each represents oxygen or sulfur), or a pharmaceutically acceptable salt of the compound. (I) (II)

(57) 要約: 例えば下記式(I)(式中、 R^1 、 R^2 および R^3 は同一または異なって水素原子、低級アルキル、低級アルケールまたは低級アルキニルを表し、 R^4 はシクロアルキル、 $-(CH_2)_n - R^5$ または下記式(II)を表し、 X^1 および X^2 は同一または異なって酸素原子または硫黄原子を表す)で表されるキサンチン誘導体等のアデノシン A_{2A} 受容体拮抗作用を有する化合物またはその薬理学的に許容される塩を有効成分として含有する慢性筋骨格痛を呈する疾患の予防および/または治療剤を提供する。